

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



PCT

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
16. Juni 2005 (16.06.2005)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/054246 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07D 487/04**,  
231/38, 249/14, A61K 31/519, C07D 471/14, A61P 35/00

AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/012523

(22) Internationales Anmeldedatum:  
5. November 2004 (05.11.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
103 56 579.5 4. Dezember 2003 (04.12.2003) DE

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL,  
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,  
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter  
Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

Veröffentlicht:  
— mit internationalem Recherchenbericht  
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden  
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen  
eintreffen

(72) Erfinder; und  
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHIEMANN,  
Kai [DE/DE]; Am Rödergraben 8, 64342 Seeheim-Ju-  
genheim (DE). HÖLZEMANN, Günter [DE/DE];  
Gutenbergstrasse 6B, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE).  
RAUTENBERG, Wilfried [DE/DE]; Magdeburger  
Strasse 13, 64354 Reinheim (DE).

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 28. Juli 2005

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH;  
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

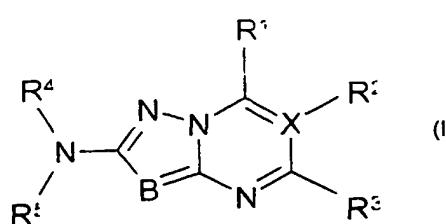
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,

WO 2005/054246 A3

(54) Title: AMINE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: AMINDERivate MIT TYROSINKINASE HEMMENDER WIRKUNG



(57) Abstract: Compounds of formula (I), wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, B and X have the meanings cited in Claim 1, are inhibitors of tyrosinkinases, particularly TIE-2, and Raf kinases and can be used inter alia in the treatment of tumors.

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I) worin R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, B und X die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, sind In-  
hibitoren der Tyrosinkinasen, insbesondere TIE-2, und der Raf-Kinasen und  
können u.a. zur Behandlung von Tumoren eingesetzt werden.